

# PATENT ABSTRACTS OF JAPAN

(11)Publication number : 11-302131

(43)Date of publication of application : 02.11.1999

---

(51)Int.Cl. A61K 7/06  
A61K 31/465  
A61K 31/505  
A61K 35/78  
A61K 45/06

---

(21)Application number : 10-121876

(71)Applicant : SHISEIDO CO LTD

(22)Date of filing : 15.04.1998

(72)Inventor : NAKAZAWA YOSUKE

MAGARA TSUNAO

TAJIMA MASAHIRO

---

## (54) COSMETIC FOR SCALP AND HAIR

### (57)Abstract:

PROBLEM TO BE SOLVED: To obtain a cosmetic for scalp and hair, having excellent blood flow-promoting effect and excellent also in safety.

SOLUTION: This cosmetic for scalp and hair comprises a blood flow-promoting agent (preferably one or more agents selected from blood flow-promoting agents of a group comprising nicotinic acids and minoxidils) and Cuachalalate extract. Furthermore, the above blood flow-promoting agent is formulated in an amount of 0.001-5.0 wt.% and the above Cuachalalate extract is formulated in an amount of 0.0001-20.0 wt.% based on whole cosmetic.

(19)日本国特許庁 (JP)

(12) 公開特許公報 (A)

(11)特許出願公開番号

特開平11-302131

(43)公開日 平成11年(1999)11月2日

(51)Int.Cl<sup>6</sup>

A 61 K 7/06

31/465

31/505

35/78 ADT

45/06 ADA

識別記号

P I

A 61 K 7/06

31/465

31/505

35/78 ADTK

45/06 ADA

審査請求 未請求 詛求項の数 2 FD (全 8 頁)

(21)出願番号

特願平10-121876

(22)出願日

平成10年(1998)4月15日

(71)出願人 000001959

株式会社資生堂

東京都中央区銀座7丁目5番5号

(72)発明者 中沢 陽介

神奈川県横浜市港北区新羽町1050番地 株式会社資生堂第1リサーチセンター内

(72)発明者 真柄 純夫

神奈川県横浜市港北区新羽町1050番地 株式会社資生堂第1リサーチセンター内

(72)発明者 田島 正裕

神奈川県横浜市港北区新羽町1050番地 株式会社資生堂第1リサーチセンター内

(74)代理人 弁理士 志村 光春

(54)【発明の名称】 頭皮頭髪用化粧料

(57)【要約】

【課題】 優れた血流促進効果を有し、かつ安全性にも優れる頭皮頭髪用化粧料を提供すること。

【解決手段】 血流促進剤（好ましくは、ニコチン酸類及びミノキシジル類からなる群の血流促進剤から選ばれる1種又は2種以上）及びクアチャララーテ抽出液を含有する頭皮頭髪用化粧料を提供することにより、上記課題が解決され得ることを見出した。

## 【特許請求の範囲】

【請求項1】 血流促進剤及びクアチャララー $\alpha$ 抽出液を含有する頭皮頭髪用化粧料。

【請求項2】 血流促進剤が、ニコチン酸類及びミノキシジル類からなる群の血流促進剤から選ばれる1種又は2種以上の血流促進剤である請求項1記載の頭皮頭髪用化粧料。

## 【発明の詳細な説明】

## 【0001】

【発明の属する技術分野】本発明は、頭皮頭髪用化粧料（以下、頭髪用化粧料という）に関する技術分野の発明である。より詳細には、優れた血流促進効果を有し、かつ安全性にも優れる頭髪用化粧料に付し、本発明頭髪用化粧料は、特に医薬品、医薬部外品又は化粧品の分野において用いられる。

## 【0002】

【従来の技術】頭髪用化粧料には、様々な種類があり、様々な頭皮頭髪状態に対応した製品が存在している。例えば、頭皮部分の血流循環を良好にすることによって、脱毛状態等を改善し得る製品が開発されている。頭皮における様々なトラブルは、高齢化社会を迎えた今日では、社会的ストレスの増大も伴って増加しつつあり、この頭皮におけるトラブルに対応した頭髪用化粧料の需要は急増している。一般に、頭部の禿や脱毛の原因としては、毛包上部の皮脂腺等の器官における男性ホルモンの活性化、毛乳頭や毛包への血流量の低下による栄養物質の供給不足、上皮組織の角化異常等によるふけの過剝発生、過剝な皮脂分泌、過酸化脂質の生成、ストレス等が挙げられる。また、丈夫で美しい毛髪を育てるうえで、毛乳頭や毛包への十分な栄養補給が大切である。毛乳頭や毛包への血流量の低下は、栄養不足や老廃物の排泄の機能の低下を招き、細毛ややせ毛の原因となる。

【0003】このような観点から、少なくとも頭皮における血流機能の低下を改善することは、頭皮及び頭髪のトラブルを解決する上で欠かせないポイントとなる。従来の頭髪用化粧料は、一般に、上述したような禿や脱毛等の原因と考えられる要素を取り除いたり、軽減する作用を持つ物質を配合したものである。例えば、頭皮における血液循環を良好にすることのために、センブリエキス、ビタミンE及びその誘導体、アセチルコリン誘導体、セファランチン等の血流促進剤、トウガラシチンキ等の局所刺激剤が配合され、過剝な皮脂分泌等により起こる頭皮の炎症を抑制するために紫根エキス等の消炎剤が配合され、男性ホルモンを抑制するためにエストラジオール等の女性ホルモン剤が配合され、ふけやかゆみを防止するためにサリチル酸等の抗菌剤が配合され、また、毛包等への栄養補給のためにセリン、メチオニン等のアミノ酸類、ビタミン類等が配合され、禿や脱毛、毛髪の細り等の予防及び治療に用いられている。

## 【0004】

【発明が解決しようとする課題】しかしながら、これらの成分を少量のみ頭髪用化粧料中に配合しても十分な効果を得ることは難しく、逆に、大量に配合すると使用部分及びその周辺に不快な刺激感や発赤を伴う傾向が強まり、必ずしもその配合量には限界があった。

【0005】そこで本発明が解決すべき課題は、優れた血流促進効果を有し、かつ安全性にも優れる頭髪用化粧料を提供することである。

## 【0006】

【課題を解決するための手段】本発明者は、この課題の解決に向けて試験を行った。その結果、従来から頭髪用化粧料で使用されている血流促進剤と、クアチャララー $\alpha$ 抽出液とを組み合わせて配合することにより、優れた血流促進効果や発毛効果、毛髪の細りの防止効果を有し、かつ安全性にも優れる頭髪用化粧料が提供されることを見出し、本発明を完成した。

【0007】すなわち本発明は、血流促進剤及びクアチャララー $\alpha$ 抽出液を含有する頭髪用化粧料を提供する発明である。

【0008】また、上記の血流促進剤が、ニコチン酸類及びミノキシジル類からなる群の血流促進剤から選ばれる1種又は2種以上の血流促進剤である場合が、特に所定の効果を有効に發揮し得る。

## 【0009】

【発明の実施の形態】以下、本発明の実施の形態について説明する。本発明頭髪用化粧料は、血流促進剤とクアチャララー $\alpha$ 抽出液とを組み合わせて配合することにより、所期の効果を発揮する頭髪用化粧料である。

【0010】本発明頭髪用化粧料中に配合可能な血流促進剤は、それを皮膚上に塗布すると、血流が促進され、かつ外用剤の配合成分として安全性上問題がない限り、特に限定されるものではなく、その作用機序も問われるべきものではない。

【0011】具体的には、ニコチン酸及びその誘導体（本願においては、これをニコチン酸類と定義する）、ミノキシジル並びにその誘導体及びその類縁体（本願においては、これをミノキシジル類と定義する）、セファンチン、ビタミンE及びその誘導体、 $\gamma$ -オリザノール、アルコキシカルボニルビリシンN-オキシド、塩化カブロニウム、アセチルコリン及びその誘導体等の従来から毛髪化粧料に血流促進剤として配合されているものを適宜選択することができる。また、これらの血流促進剤を単独で本発明頭髪用化粧料に配合することも可能であるが、2種以上を組み合わせて配合することも可能である。

【0012】これらの血流促進剤のうちでも特に、ニコチン酸類及びミノキシジル類から1種又は2種以上を選択して本発明頭髪用化粧料中に配合することが好ましい。

【0013】ニコチン酸誘導体としては、例えばニコチ

ン酸ベンジル、ニコチン酸トコフェロール、ニコチン酸 $\beta$ -ブロキシエチル、ニコチン酸アミド等を挙げることができる。これらのニコチン酸類は現在市販されており、また、通常公知の方法で製造することができる。

【0014】また、ミノキシジルは、末梢血管拡張作用を有し、難治性の高血圧症の治療に用いられてきたが、その副作用として多毛症が認められたことから、局所外用剤として利用されるに至った物質であり（米国特許第4139619号、同第4596812号）、その化学名は、6-(1-ビメリジニル)-2,4-ピリミジンアミン-3-オキサイドである。

【0015】ミノキシジル試導体としては、このミノキシジルの塩等を挙げることが可能であり、ミノキシジル類導体としては、ミノキシジルの抱合体を挙げができる。

【0016】これらのミノキシジル類は現在市販されており、また、通常公知の方法で製造することができる。

【0017】本発明頭髪用化粧料においては、上記の血流促進剤は、頭髪用化粧料全体に対して0.001～5.0重量%の範囲で配合されるのが好ましく、同0.01～2.0重量%の範囲で配合されるのが特に好ましい。血流促進剤の配合量が、頭髪用化粧料全体に対して0.001重量%未満であると十分な血流促進効果が得られず好ましくない。また、頭髪用化粧料全体に対して5.0重量%を超えると、皮膚刺激等が伴う等、安全性の側面から問題が生じる恐れがあり好ましくない。

【0018】上記の血流促進剤と共に本発明毛髪化粧料中に配合される、クアチャララーテ抽出液は、特にメキシコ南部太平洋沿岸のアカブルコ地方等に生えているクアチャララーテ (*Cuachalalate*, 学名: *Juliania adstrigens*) といふ植物から得られる抽出液であり、創傷治癒、間接熱、歯内強健、消化器系がん、脱毛等に有効であることがすでに知られており（特開平4-181313号公報）、さらに、プロテアーゼ阻害作用を有することも見い出されている。このクアチャララーテ抽出液は、例えば、クアチャララーテの葉、茎、花、樹皮、種子、果実、植物全草等を、溶媒に浸漬又は溶媒と共に加熱還流した後、ろ過し、濃縮して得ることができる。また、このようにして得られた濃縮液に、溶媒を用いて分離、クロマトグラフィー等の精製等の処理をさらに加えて得られたものを、本発明毛髪化粧料において用いることもできる。溶媒としては、通常植物の抽出に用いられる溶媒であれば、任意に用いることができ、例えば、メタノール、エタノール等のアルコール類、含水アルコール類、アセトン、酢酸エチル等の有機溶媒を、単独で又は組み合わせて用いることができる。

【0019】本発明頭髪用化粧料中におけるクアチャラーテ抽出液の配合量は、頭髪用化粧料全体に対して0.0001重量%～20.0重量%が好ましく、同

0.05重量%～5.0重量%が特に好ましい。

【0020】この配合量が頭髪用化粧料全体に対して0.0001重量%未満では、十分な血流促進効果が得られず好ましくなく、同20.0重量%を超えると、製剤上不都合を生ずる傾向が強くなり、また皮膚刺激性が生ずる等の点から好ましくない。

【0021】このようにして、上記血流促進剤と、上記クアチャララーテ抽出液とを組み合わせて配合することにより、優れた血流促進効果を有し、かつ安全性にも優れる本発明頭髪用化粧料が提供される。

【0022】なお、本発明頭髪用化粧料中には、通常頭髪用化粧料中に配合される薬効成分を、その薬効成分が有する一般的な効果を発揮させる目的のために、本発明の所期の効果を損なわない限りにおいて配合することも可能である。

【0023】例えば、トウガラシチンキ、カンタリスエキス、カンフル、ノニル酸バニルアミド等の局所刺激剤；ビリドキシン若しくはその誘導体、イオウ、ビタミンB<sub>6</sub>等の抗脂漏剤；塩化ベンザルコニウム、イソプロ

20 ピルメチルフェノール、レゾルシン、ジンクピリヂオン、感光素101号、感光素102号、サリチル酸、サリチル酸ナトリウム、オルトピロックス、ヒノキチオール等の抗菌剤；感光素301号、プラセンタエキス、ビオチン等の代謝賦活剤；グリチルリチン酸、グリチルレチン酸、若しくはそれらの誘導体、紫根エキス、メントール等の消炎剤；エストラジオール、エストロン等の女性ホルモン；セリン、メチオニン、トリプトファン等のアミノ酸類、ビタミンA、B<sub>1</sub>、B<sub>2</sub>、D、パントテン酸若しくはその誘導体等のビタミン類等を本発明頭髪用化粧料中に配合することもできる。

【0024】また、通常頭髪用化粧料中に配合される植物抽出物、例えばアルテア抽出物、ヨクイニン抽出物、ペバーミント抽出物、ヨウトイ抽出物、トウガラシ抽出物、アロエ抽出物、クコ抽出物、ヨモギ抽出物、イネ抽出物、マンケイシ抽出物、マンナンロウ抽出物、コッサイボ抽出物、エニシダ抽出物、リンドウ抽出物、タンジン抽出物、ヘチマ抽出物、キキョウ抽出物、マツ抽出物、クシン抽出物、トウキ抽出物、ベニバナ抽出物、メギ抽出物、ビンロウジ抽出物、ユーカリ抽出物、カゴソウ抽出物、モクソウ抽出物、ゴシツ抽出物、サイコ抽出物、チャ抽出物、カンゾウ抽出物、ホップ抽出物、キク抽出物、セネガ抽出物、ゴマ抽出物、センキュウ抽出物、カシュウ抽出物、カッコン抽出物、マイカイカ抽出物、サフラン抽出物、ローズマリー抽出物、ジオウ抽出物、ゼニアオイ抽出物等を、血流促進作用以外の作用に着目して、本発明頭髪用化粧料中に配合することができる。

【0025】また、亜鉛若しくはその誘導体；乳酸若しくはそのアルキルエステル等；コハク酸、リンゴ酸、クエン酸等の有機酸類；トラネキサム酸等のプロテアーゼ

50 抗凝固活性剤等を本発明頭髪用化粧料中に配合することができる。

阻害剤；オリーブ油、スクワラン、流動パラフィン、イソプロピルミリストート、高級脂肪酸、高級アルコール等の油分；グリセリン、プロビレンギリコール等の多価アルコール；その他界面活性剤、保湿剤、増粘剤、酸化防止剤、紫外線吸収剤、清涼剤、香料、色素、エタノール、水等を本発明の所期の効果を損なわない範囲で適宜配合することができる。

【0026】本発明頭髪用化粧料の形態は、液状、乳液、軟膏、クリーム、ゲル、エアゾール等、外皮に適用可能な性状のものであれば問わるものではなく、必要に応じて適宜基剤成分等を配合して、所望する製品形態の本発明頭髪用化粧料を調製することができる。また、本発明頭髪用化粧料は、医薬品、医薬部外品又は化粧料等の多様な分野において適用可能である。

【0027】本発明頭髪用化粧料は、頭皮の血流を促進させることにより解決可能なトラブル、例えば脱毛やふけ、かゆみ等の治療や予防に用いることが可能であり、例えば男性性脱毛症の治療や予防、女性に多いびまん性脱毛症の治療や予防、円形脱毛症の治療等に広く用いることができる。ただし、ここに示した目的は例示であり、これらの目的に本発明頭髪用化粧料の適用可能な疾患が限定されるものではない。

【0028】本発明頭髪用化粧料は、概ね皮膚に直接塗布又は散布する等の経皮投与により投与される（なお、本発明頭髪用化粧料においては、上記必須成分の組み合わせ配合により、成分の経皮吸収が促進される）。そして、本発明頭髪用化粧料の投与量は、年齢、脱毛の程度等の個人差やその製剤形態に応じて適宜決定されるべきものであるが、一般の大人にに対する投与量は、体重1kg当たり0.001～10.0mg/日、好ましくは0.1～1.0mg/日であり、これを1日2～4回に分けて投与することができる。

【0029】

【実施例】以下、実施例等により本発明をより具体的に説明するが、これらの実施例等により本発明の技術的範囲が限定されるべきものではない。なお、これらの実施例等における配合量は、特に断らない限り、その成分が配合される系全体に対する重量%である。まず、各実施例等の開示に先立ち、これらの実施例等の血流促進効果等を検討するための試験について説明する。

【0030】1. レーザードッパー法による血流量試験

レーザードッパー法、すなわち、ALF-2100（アドバンス社製）を用い、皮膚にレーザーを当て、そ

の反射光のずれ（ドップラー効果）を利用して血流量の変化を測定する方法により、試験品の塗布前後の血流量の変化を測定した。すなわち、下記の実施例1～8及び比較例1～4について、各6名のパネルを用い、前腕内側において血流量を測定した。そして、これらのサンプル1mlを前腕内側2cm×2cm角に塗布した。塗布30分後に再度血流量を測定し、その変化の度合いによって血流促進効果を評価した。

【0031】それらの測定は各パネルについて5回行い、6名の平均値から以下のように評価した。

<評価基準>

+++：血流量が3倍以上増加しており、極めて著しい血流促進効果が認められた。

++：血流量が2倍以上増加しており、著しい血流促進効果が認められた。

+：血流量が1.5倍以上増加しており、かなりの血流促進効果が認められた。

±：血流量が1.0倍以上、1.5倍未満増加しており、やや血流促進効果が認められた。

-：血流量の増加が認められず、血流促進効果が認められなかった。

【0032】2. 発毛試験

下記の実施例1～8及び比較例1～4のサンプルについて、発毛試験を、毛周期の休止期にあるC3H/HeNCrマウスを用い、小川らの方法（ノーマル・アンド・アブノーマル・エピダーマル・ディファレンシエーション(Normal and Abnormal Epidermal Differentiation), M. Seiji 及び I.A. Bernstein編集, 第159～170頁, 1982年, 東大出版）に従って行った。

【0033】すなわち、マウス1群を10匹とし、無塗布、実施例1～8及び比較例1～4の各群に分け、バリカン及びシェーバーでマウスの背部を剃毛し、それぞれのサンプルを1日1回、1mlずつ塗布した。各サンプルの発毛効果は、30日後の各マウスの背部の発毛率（%）（＝発毛部分の面積／剃毛部分の面積×100）の平均値によって評価した。

【0034】【実施例1～8、比較例1～4】第1表（実施例1～8）及び第2表（比較例1～4）に示した配合成分のローションを後述する製法に従って調製し、上記血流量試験及び発毛試験を行った。これらの結果も併せて第1表及び第2表に示す。

【0035】

【表1】

第1表

各配合成分の数量は重量%

配合成分	実施例							
	1	2	3	4	5	6	7	8
クアチャラーテ 稀止液	3.0	3.0	3.0	3.0	3.0	3.0	3.0	3.0
ニコチン酸アミド	0.001	5.0	-	-	0.5	2.0	-	0.05
ミノキシジル	-	-	0.001	5.0	1.0	-	3.0	2.0
グリセリン				5.0				
硬化ヒマシ油エチレン オキシド(2.9モル) 付加物					1.5			
乳酸					0.05			
乳酸ナトリウム					0.05			
香料及び色素					0.05			
0.5%エタノール				過量				
精製水					既示			
血流試験	++	+++	++	+++	+++	+++	+++	+++
発毛試験	75%	87%	78%	87%	86%	82%	88%	86%

【0036】

【表2】

第2表  
各配合成分の数字は重量%

配合成分	比較例			
	1	2	3	4
クアチャラーテ抽出液	-	-	-	9.0
ニコチン酸アミド	-	5.0	-	-
ミノキシジル	-	-	5.0	-
グリセリン			5.0	
硬化ヒマシ油エチレンオキシド(20モル)付加物			1.5	
乳酸			0.05	
乳酸ナトリウム			0.05	
香料及び色素			0.05	
9.5%エタノール			適量	
精製水			残部	
血流促進試験	±	+	+	+
発毛試験	5%	15%	45%	75%

【0037】<製法>9.5%エタノールに、各薬剤(クアチャラーテ抽出液、ニコチン酸アミド及び/又はミノキシジル)、グリセリン、硬化ヒマシ油エチレンオキシド(20モル)付加物及び香料を溶解させた。(エタノール相)。次いで精製水に、乳酸、乳酸ナトリウム及び色素を添加した後、溶解させて、これを前記エタノール相に添加した後、攪拌することにより、透明液状のローションを得た。

【0038】第1表及び第2表に示した結果より、ニコチン酸アミド及びミノキシジルのいずれか一方又は両方とクアチャラーテ抽出液とを配合した実施例のローションには、血流量を使用後増加させる血流促進効果及び発毛効果が顕著に認められたが、これらの血流促進剤とクアチャラーテ抽出液のいずれかを配合した比較例の\*

\*ローションは、たとえこれらの成分を相当量配合しても、血流促進効果及び発毛効果共に、上記実施例の結果と比べて著しく劣っていた。

【0039】すなわち、血流促進剤とクアチャラーテ抽出液とを組み合わせて配合した本発明頭髪用化粧料においては、相乗的な血流促進効果及び発毛効果が頭著に認められることが明らかになった。このことは、少量の有効成分であっても本発明頭髪用化粧料においては所望する効果を得ることが可能であり、これらの成分を多量に配合することによって惹起される、塗布部及びその周辺部の不快な刺激感や発赤を防ぐことが可能になったことを示すものである。

【0040】以下、さらに他の本発明頭髪用化粧料の処方例を示す。

## 〔実施例9〕 薬用トニック

(配合成分)	配合量(重量%)
9.5%エタノール	60.0
クアチャラーテ抽出液	8.0
ニコチン酸β-ブトキシエチル	0.03
酢酸トコフェロール	1.0
プロビレングリコール	3.0
コハク酸	適量

(7)

特開平11-302131

11

## 香料及び色素

硬化ヒマシ油エチレンオキシド(5モル)付加物

精製水

12

## 適 置

1. 5

残 部

【0041】<調法>95%エタノールに、クアチャララーチ抽出液、ニコチン酸β-ブトキシエチル、酢酸トコフェロール、プロピレングリコール、硬化ヒマシ油エチレンオキシド(5モル)付加物及び香料を溶解させた。(エタノール相)。次いで精製水に、コハク酸及び色素を添加した後、溶解させて、これを前記エタノール相に添加した後、搅拌することにより、透明液状の薬用\*10

\*トニックを得た。

【0042】この本発明頭髪用化粧料に上記試験を行ったところ、血流量試験においては著しい血流量の増加が認められ、発毛試験においては発毛率85%の結果が得られた。

【0043】

## 【実施例10】 薬毛ローション

## (配合成分)

95%エタノール

クアチャララーチ抽出液

ミノキシジル

セファランチン

トコフェロール

## 配合量(重量%)

70. 0

4. 0

1. 0

0. 5

△ △

が得られた。

## \* \* 【0049】

## 〔実施例12〕 頭皮マッサージ剤

## (配合成分)

	配合量(重量%)
95%エタノール	45.0
クアチャラーテ抽出液	1.0
ニコチン酸アミド	0.8
ニコチン酸ベンジル	0.05
ダイナマイトイセリン	5.0
1, 3-ブチレングリコール	8.0
ジプロピレングリコール	4.5
増粘剤	3.0
メチルバラベン	0.2
香料及び色素	適量
精製水	残部

【0050】<調法>精製水の一部に増粘剤を加え、溶解増粘させた後、別に、残りの精製水に溶かした色素を加えた(水相)。この水相に、ダイナマイトイセリン、1, 3-ブチレングリコール及びジプロピレングリコールを加えて混合したところへ、95%エタノールに溶解させたクアチャラーテ抽出液、ニコチン酸アミド、ニコチン酸ベンジル、メチルバラベン及び香料を添加した後、攪拌してジェル状の頭皮マッサージ剤を得

た。

【0051】この本発明頭髪用化粧料に上記試験を行ったところ、血流量試験においては著しい血流量の増加が認められ、発毛試験においては発毛率90%の結果が得られた。

## 20 【0052】

【発明の効果】本発明により、優れた血流促進効果を有し、かつ安全性にも優れる頭髪用化粧料が提供される。